

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2004 年 7 月 15 日 (15.07.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/058728 A1(51) 国際特許分類: C07D 237/20, 401/04, 513/04,
213/75, 471/04, 413/12, 401/14, A61K 31/444, 31/4545,
31/50, 31/5377, 31/541, 31/496, 31/55, 31/4439, 31/437,
A61P 7/02, 9/00, 9/04, 9/10, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2003/016556

(22) 国際出願日: 2003 年 12 月 24 日 (24.12.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2002-373025
2002 年 12 月 24 日 (24.12.2002) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 第一
製薬株式会社 (DAIICHI PHARMACEUTICAL CO.,
LTD.) [JP/JP]; 〒103-8234 東京都中央区日本橋 3 丁
目 1 4 番 1 0 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 中本 有美
(NAKAMOTO, Yumi) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都江
戸川区北葛西 1 丁目 1 6-1 3 第一製薬株式
社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 吉野 利治
(YOSHINO, Toshiharu) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都江
戸川区北葛西 1 丁目 1 6-1 3 第一製薬株式
社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 内藤 博之
(NAITO, Hiroyuki) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都江
戸川区北葛西 1 丁目 1 6-1 3 第一製薬株式
社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 永田 勉
(NAGATA, Tsutomu) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都江
戸川区北葛西 1 丁目 1 6-1 3 第一製薬株式
社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 吉川 謙次 (YOSHIKAWA, Kenji)
[JP/JP]; 〒134-8630 東京都江戸川区北葛西 1 丁目
1 6-1 3 第一製薬株式会社東京研究開発センター
内 Tokyo (JP). 鈴木 誠 (SUZUKI, Makoto) [JP/JP]; 〒
134-8630 東京都江戸川区北葛西 1 丁目 1 6-1 3 第
一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP).(74) 代理人: 特許業務法人アルガ特許事務所 (THE
PATENT CORPORATE BODY ARUGA PATENT
OFFICE); 〒103-0013 東京都中央区日本橋人形町 1
丁目 3 番 6 号共同ビル Tokyo (JP).(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR,
HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR,
LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ,
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (BW, GH, GM, KE, LS,
MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特
許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロ
パ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK,
TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).添付公開書類:
— 国際調査報告書2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: NOVEL ETHYLENEDIAMINE DERIVATIVES

(54) 発明の名称: 新規なエチレンジアミン誘導体

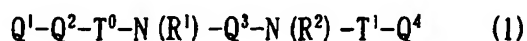
(57) Abstract: A compound represented by the following general formula (1): $Q^1-Q^2-T^0-N(R^1)-Q^3-N(R^2)-T^1-Q^4$ (1) wherein R^1 and R^2 represent each hydrogen, etc.; Q^1 represents optionally substituted and saturated or unsaturated 5- to 6-membered cyclic hydrocarbyl, etc.; Q^2 represents a single bond, etc.; Q^3 represents a group $-C(R^{3a})(R^{4a})-[C(R^{3b})(R^{4b})]m^1-[C(R^{3c})(R^{4c})]m^2-[C(R^{3d})(R^{4d})]m^3-[C(R^{3e})(R^{4e})]m^4-C(R^{3f})(R^{4f})$ (wherein R^{3a} to R^{4e} represent each hydrogen, etc.); T^0 represents carbonyl, etc.; and T^1 represents $-COCONR-$, etc.; its salt, solvates thereof or N-oxides of the same. These compounds are useful as preventives and/or remedies for cerebral infarction, cerebral embolism, myocardial infarction, angina, pulmonary infarction, pulmonary embolism, Burger's disease, deep venous thrombosis, disseminated intravascular coagulation syndrome, thrombosis after artificial valve/joint replacement, thrombosis and reocclusion after reconstructing blood circulation, systemic inflammatory response syndrome (SIRS), multiorgan dysfunction syndrome (MODS), thrombosis in extracorporeal circulation and blood coagulation in blood collection.

〔続葉有〕



(57) 要約:

一般式 (1)



[式中、 R^1 および R^2 は水素原子などを、 Q^1 は置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基などを、 Q^2 は単結合などを、 Q^3 は下記の基—C(R^{3a})(R^{4a})—{C(R^{3b})(R^{4b})} m^1 —{C(R^{3c})(R^{4c})} m^2 —{C(R^{3d})(R^{4d})} m^3 —{C(R^{3e})(R^{4e})} m^4 —C(R^{3f})(R^{4f})—

($R^{3a} \sim R^{4e}$ は水素などを示す)を、 T^0 はカルボニル基などを、 T^1 は—COCONR—などを示す。]で表される化合物、その塩、それらの溶媒和物またはそれらのN-オキシド。

脳梗塞、脳塞栓、心筋梗塞、狭心症、肺梗塞、肺塞栓、パージャージャー病、深部静脈血栓症、汎発性血管内凝固症候群、人工弁／関節置換後の血栓形成、血行再建後の血栓形成および再閉塞、全身性炎症性反応症候群(SIRS)、多臓器不全(MODS)、体外循環時の血栓形成または採血時の血液凝固の予防剤および／または治療剤として有用である。